

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】令和6年3月25日(2024.3.25)

【公開番号】特開2023-70678(P2023-70678A)

【公開日】令和5年5月19日(2023.5.19)

【年通号数】公開公報(特許)2023-092

【出願番号】特願2022-209755(P2022-209755)

【国際特許分類】

A 61K 47/68(2017.01)

10

A 61K 45/00(2006.01)

A 61P 43/00(2006.01)

A 61P 35/00(2006.01)

C 07K 1/113(2006.01)

C 07K 16/28(2006.01)

C 07K 19/00(2006.01)

C 12N 15/13(2006.01)

【F I】

A 61K 47/68 Z N A

20

A 61K 45/00

A 61P 43/00 1 1 1

A 61P 43/00 1 2 1

A 61P 35/00

C 07K 1/113

C 07K 16/28

C 07K 19/00

C 12N 15/13

【手続補正書】

【提出日】令和6年3月8日(2024.3.8)

30

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

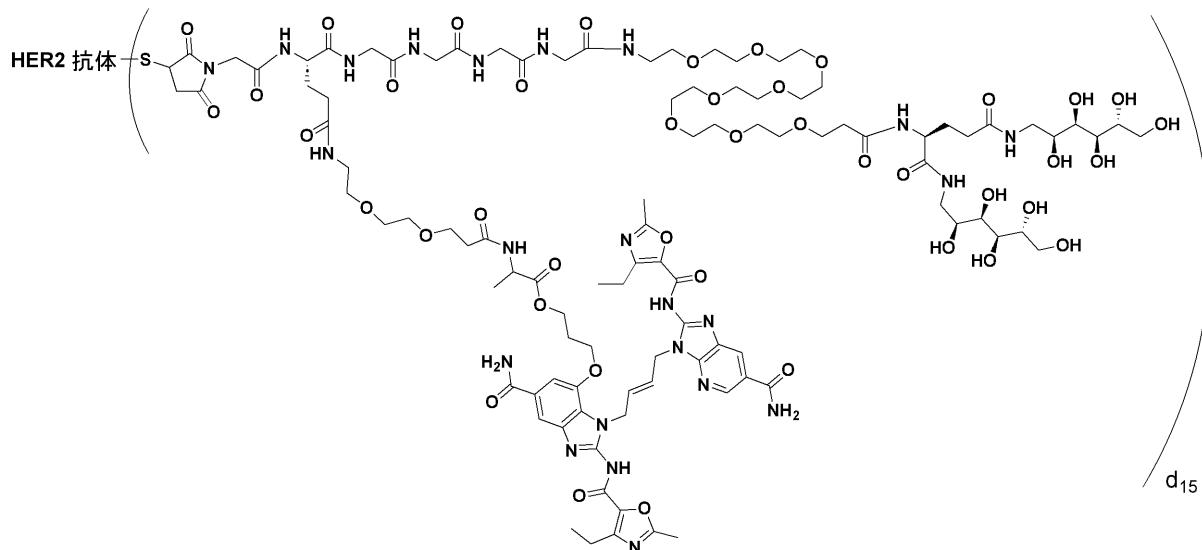
【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下

40

50



10

である、抗体-薬物コンジュゲート(ADC)、またはその薬学的に許容される塩もしくは立体異性体であって、式中、

HER2抗体は、アミノ酸配列FTFSSYSMN (SEQ ID NO: 20)を含む可変重鎖相補性決定領域1(CDRH1);アミノ酸配列YISSSSSTIYYADSVKG (SEQ ID NO: 21)を含む可変重鎖相補性決定領域2(CDRH2);およびアミノ酸配列GGHGYFDL (SEQ ID NO: 22)を含む可変重鎖相補性決定領域3(CDRH3);並びにアミノ酸配列RASQSVSSSYLA (SEQ ID NO: 27)を含む可変軽鎖相補性決定領域1(CDRL1);アミノ酸配列GASSRAT (SEQ ID NO: 28)を含む可変軽鎖相補性決定領域2(CDRL2);およびアミノ酸配列QQYHHSPLT (SEQ ID NO: 29)を含む可変軽鎖相補性決定領域3(CDRL3)を含み、d₁₅は、約1～約20の範囲の整数を表す、

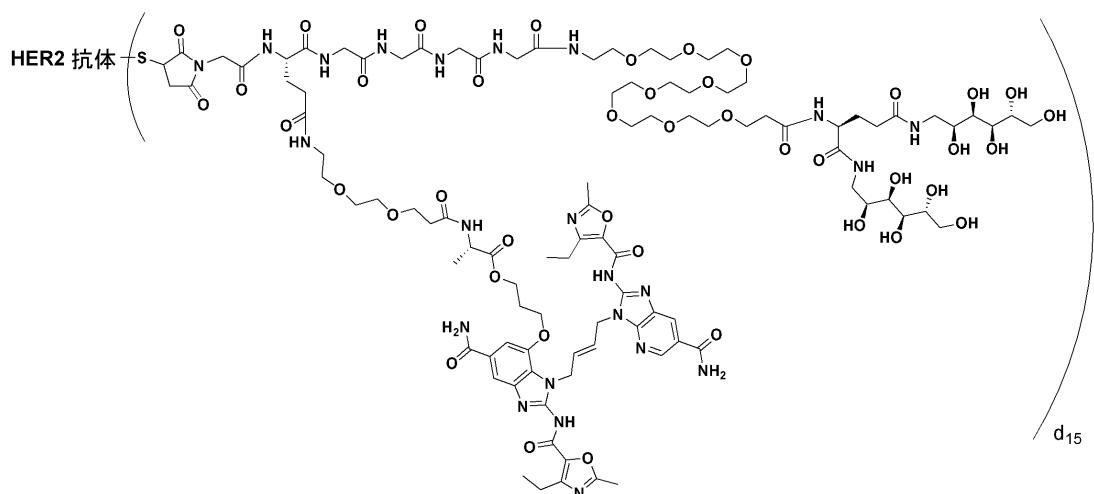
20

前記抗体-薬物コンジュゲート(ADC)、またはその薬学的に許容される塩もしくは立体異性体。

【請求項2】

30

以下



40

である、抗体-薬物コンジュゲート(ADC)、またはその薬学的に許容される塩もしくは立体異性体であって、式中、

HER2抗体は、アミノ酸配列FTFSSYSMN (SEQ ID NO: 20)を含む可変重鎖相補性決定領域1(CDRH1);アミノ酸配列YISSSSSTIYYADSVKG (SEQ ID NO: 21)を含む可変

50

重鎖相補性決定領域2(CDRH2);およびアミノ酸配列GGHGYFDL(SEQ ID NO:22)を含む可変重鎖相補性決定領域3(CDRH3);並びにアミノ酸配列RASQSVSSSYLA (SEQ ID NO: 27)を含む可変軽鎖相補性決定領域1(CDRL1);アミノ酸配列GASSRAT(SEQ ID NO: 28)を含む可変軽鎖相補性決定領域2(CDRL2);およびアミノ酸配列QQYHHSPLT(SEQ ID NO: 29)を含む可変軽鎖相補性決定領域3(CDRL3)を含み、 d_{15} は、約1~約20の範囲の整数を表す。

前記抗体-薬物コンジュゲート(ADC)、またはその薬学的に許容される塩もしくは立体異性体。

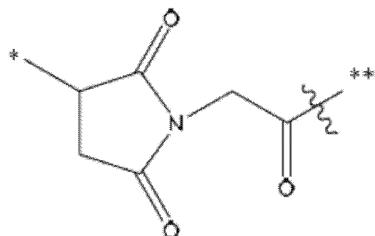
【請求項3】

式(1):

PBRM-[A¹-(L^C)-D]_{d15}(1)

の抗体-薬物コンジュゲート、またはその薬学的に許容される塩であって、式中、

A¹は、



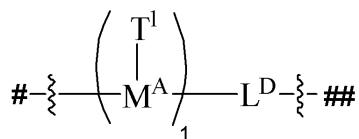
10

20

であり、式中、

—*—は、PBRMに取り付けられていることを示し、—**—は、L^Cに取り付けられていることを示し、

L^Cは、

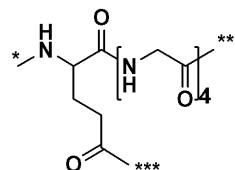


30

であり、式中、

#は、A¹に取り付けられていることを示し、##は、Dに取り付けられていることを示し、

MAは、



40

であり、式中、

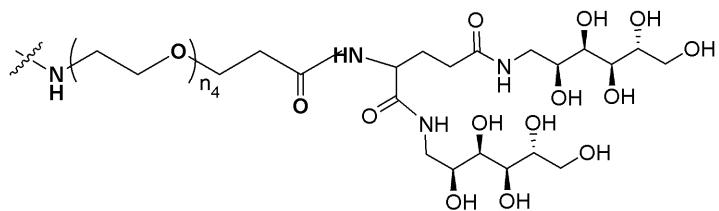
—*—はA¹に取り付けられていることを示し、—**—はT¹に取り付けられていることを示し、—**—はL^Dに取り付けられていることを示し、

—LDは、***-NH-(CH₂CH₂O)₂-(CH₂)₂-C(O)-(アラニン)-****であり、式中、—***—は

MAに取り付けられていることを示し、—***—は、Dに取り付けられていることを示し、

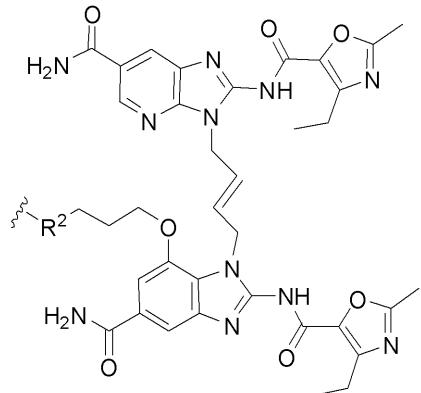
T¹は

50



であり、式中、 n_4 は8であり、
 D は、

10



20

であり、式中、
 R^2 は-O-であり、
...
...

は、 L^D に取り付けられていることを示し、

PB RMは、アミノ酸配列FTFSSYSMN (SEQ ID NO: 20)を含む可変重鎖相補性決定領域1(CDRH1);アミノ酸配列YI SSSSSTIYYADSVKKG (SEQ ID NO: 21)を含む可変重鎖相補性決定領域2(CDRH2);およびアミノ酸配列GGHGYFDL (SEQ ID NO: 22)を含む可変重鎖相補性決定領域3(CDRH3);並びにアミノ酸配列RASQSVSSSYLA (SEQ ID NO: 27)を含む可変軽鎖相補性決定領域1(CDRL1);アミノ酸配列GASSRAT (SEQ ID NO: 28)を含む可変軽鎖相補性決定領域2(CDRL2);およびアミノ酸配列QQYHHHSPLT (SEQ ID NO: 29)を含む可変軽鎖相補性決定領域3(CDRL3)を含む、HER2抗体であり、かつ d_{15} は、約1～約20の整数を表す、

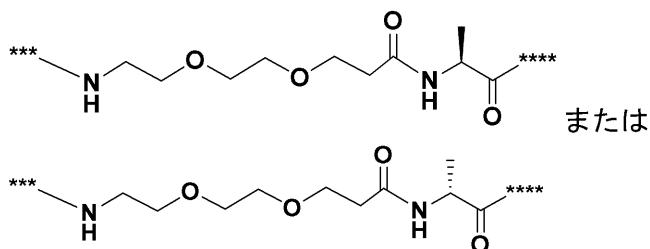
30

前記抗体-薬物コンジュゲート、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項4】

L^D が、

40



であり、式中、

50

—***は、M^Aに取り付けられていることを示し、
—***は、Dに取り付けられていることを示す。
請求項3記載のコンジュゲート。

【請求項5】

HER2抗体が、SEQ ID NO: 17に記載のアミノ酸配列を含む重鎖可変領域およびSEQ ID NO: 24に記載のアミノ酸配列を含む軽鎖可変領域を含む、請求項1～4のいずれか一項記載のコンジュゲート。

【請求項6】

HER2抗体が、SEQ ID NO: 19に記載のアミノ酸配列を含む重鎖およびSEQ ID NO: 26に記載のアミノ酸配列を含む軽鎖を含む、請求項1～5のいずれか一項記載のコンジュゲート。 10

【請求項7】

d₁₅が、約2～約14の整数を表す、請求項1～6のいずれか一項記載のコンジュゲート。

【請求項8】

d₁₅が、約2～約8の整数を表す、請求項1～7のいずれか一項記載のコンジュゲート。

【請求項9】

d₁₅が、約2、約4、約6、または約8である、請求項1～8のいずれか一項記載のコンジュゲート。

【請求項10】

d₁₅が、約6から約10の整数である、請求項1～7のいずれか一項記載のコンジュゲート。 20

【請求項11】

d₁₅が、約6である、請求項10記載のコンジュゲート。

【請求項12】

d₁₅が、約7である、請求項10記載のコンジュゲート。

【請求項13】

d₁₅が、約8である、請求項10記載のコンジュゲート。

【請求項14】

請求項1～13のいずれか一項記載のコンジュゲートまたはその薬学的に許容される塩もしくは立体異性体と1種類または複数種の薬学的に許容される担体または賦形剤を含む、薬学的組成物。

【請求項15】

少なくとも1種類のイムノモジュレーターまたは少なくとも1種類の免疫賦活剤をさらに含む、請求項14記載の薬学的組成物。

【請求項16】

請求項1～13のいずれか一項記載のコンジュゲートまたはその薬学的に許容される塩もしくは立体異性体を含む、対象においてインターフェロン遺伝子刺激因子(STING)の活性を活性化または強化するための薬学的組成物。

【請求項17】

治療的有効量の請求項1～13のいずれか一項記載のコンジュゲートまたはその薬学的に許容される塩もしくは立体異性体を含む、対象において疾患または障害を予防または処置するための薬学的組成物。

【請求項18】

疾患または障害がSTINGのアゴニズムと関連している、請求項17記載の薬学的組成物。

【請求項19】

疾患または障害ががんである、請求項17または18記載の薬学的組成物。

【請求項20】

疾患または障害が、膀胱がん、乳がん、結腸直腸がん、結腸がん、子宮内膜がん、胃がん、頭頸部扁平上皮がん、黒色腫、肺がん、卵巣がん、食道がん、胆道がん、尿路上皮が

50

30

ん、子宮頸がん、乳頭様甲状腺がん、乳頭状腎細胞がん、胆管がん、唾液管がん、腎臓がん、または膵臓がんである、請求項17～19のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項21】

疾患または障害が、乳がん、結腸直腸がん、胃がん、または肺がんである、請求項17～20のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項22】

対象においてインターフェロン遺伝子刺激因子(STING)の活性を活性化または強化するための医薬の製造における、請求項1～13のいずれか一項記載のコンジュゲートまたはその薬学的に許容される塩もしくは立体異性体、あるいは請求項14～15のいずれか一項記載の薬学的組成物の使用。

10

【請求項23】

対象において疾患または障害を予防または処置するための医薬の製造における、請求項1～13のいずれか一項記載のコンジュゲートまたはその薬学的に許容される塩もしくは立体異性体、あるいは請求項14～15のいずれか一項記載の薬学的組成物の使用。

【請求項24】

疾患または障害がSTINGのアゴニズムと関連している、請求項23記載の使用。

【請求項25】

疾患または障害ががんである、請求項23または24記載の使用。

【請求項26】

疾患または障害が、膀胱がん、乳がん、結腸直腸がん、結腸がん、子宮内膜がん、胃がん、頭頸部扁平上皮がん、黒色腫、肺がん、卵巣がん、食道がん、胆道がん、尿路上皮がん、子宮頸がん、乳頭様甲状腺がん、乳頭状腎細胞がん、胆管がん、唾液管がん、腎臓がん、または膵臓がんである、請求項23～25のいずれか一項記載の使用。

20

【請求項27】

疾患または障害が、乳がん、結腸直腸がん、胃がん、または肺がんである、請求項23～26のいずれか一項記載の使用。

30

40

50